This Page Is Inserted by IFW Operations and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning documents will not correct images, please do not report the images to the Image Problems Mailbox.

⑩ 日本国特济庁 (JP)

①特许出现公嗣

●公開特許公報(A)

昭55—162772

Dint. Cl.3	證別配号	庁内臺理番号	●公開	昭和	055年(19	80)12)	引8日
C 07 D 213/64		713 8 —4 C	•				
213/65		71384C	発明の		1		
213/68	•	713 8 —4 C	容查斯	}求	未蹈求		
213/70		7138—4 C					
213/82		71384C					
213/85		7138—4 C					
215/22		7305—4 C					
217/14		7308—4 C					
217/24		7306—4 C					
235/26		7306—4 C					
239/32		6670—4 C	※			(全(6 頁)

の日台計設例以体の製造法

尼崎市武口豆町2の5の53の30

3

②符 및 昭55—69434

圆 昭49(1974)5月22日

◎特 嘎 昭49─58244の分割

₩

①出 顋 人 塩野包製菜株式会社

大阪市京区道的町3丁目12番地

10代 理 人 弁理士 岩埼光燈

最終質に続く

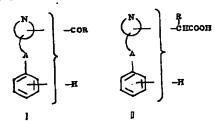


1 弱阴の名跡

回口辞口副の体の四週法

2時即取のほ田

一成式!で変わまれる化合句にアルコキシメチレン三炭化水気店目負フオスフォフンを反応ませ、て切られる化合句を加水分類しついで口化して一級式!で取わまれる化合句を切ることを特員とする口負許目同時体の負責法。



(式中、N)はピリロン、ピリミシ、イミダゾールまたはテトラゾールを取わし、Bは酸化水源芯を取わし、Aは凹窓または四日を取わし、0 当よび上記ペンセン刺上には風瓜に取口を及ばさない

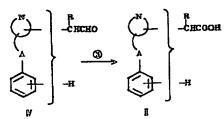


「100日以近を有していてもよくあるいは印合べ」 ンセン和立たは自合服気を有していてもよく-COR 茲はこの信合ペンゼン列上にあつてもよい。 1990の伊口な国明

本発明は包含体口科型体の図査性に関し、その目的は収れた抗炎症作用(抗リケマを作用も含む)および質質作用を示し軽減または130円として有用な包含体の口質がある。

本與明方法のほぼは次式によって示される。

(以下会白)



(会中、心はピリッン、ピリミッン、イミダゾールをたはチトラゾールを行わし、R 世段化水は転を放力し、A は一点主たは配力を戻わし、心はよび上尺ペンセン司は反応に移口を及ぼさない/~3回の回殺症を有していてもよくあるいは符合ペンセン司または符合問却を有していてもよく、一COR 益はこの符合ペンセン和上にあってもよい。 K はアルキル語を見わす。)

太烈明方法は一段式 「で最かなれる化合管をアルコキンメチレン三段化水深口段フオスフオタンと原比させるいかゆるウイティッと (Wittig) 屈比に付し(原比の)、切られる化合管 [を加水分別に付し化合管]とした(原比②) 位で化原比に

- 3 -



常不哲性気能中で行われる。初られる化合図□はついで反応③すなわち知水分別反応に付し、アルコキショチレンむをアルダヒド店にする。その知水分別は沿常エノールエーテルを加水分別する□に用いられる手敷を用いることができる。例えば、□として惣□・四□・四□をたはこれらと行即□(例えば、昨□)などとの記合物を用いることができ、惣凸として次□化アルカリ・戻□アルカリなどが用いられ次のるいは合水移□の存在下で加口するととにより買記される。生成する化合物形は母視するととなく次工程③に付すことができる。

反応③は化合はいのアルタヒド語をカルボなシル語に変えるもので一切のアルタヒド語をカルボキシル語に変えする可化反応に可じて行えばよい。
同えば記マンガン取为リウム、辺凹化水源、口化はなどにより水中なたは有句は低中で凹化してもよいし、辺凹、クロム口、特別口と到口化論・または凸凹化師凹などにより凹化してもよい。 なお上記反応①、例および②の工場において反応を受ける到上の口口語は各反応の確似に口口語を告贷



税回99-162772(2) 付して目的とする日息は日日日日日本日を日本(反応 図)ものでみる。

次に太兇弱方法の突迫について降句に記する。 反応のは恐分のウイテイツヒ反応に使つて行えば よく、罰々のアルコキシメチレン三段化水景日Q フオスフオタン(切えば.メトキレメダレントリ フエニルフオスフオラン。メトキシメテレントリ (ぉトヰシメチル)フオスフオタン。エトヰシメ チレントリプチルフオスフオランなど)が尽料化 合協と反応条件に応じて江宜辺択し使用される。 例えば、上記フオスフオタンにハロゲン化水深が 付加したフォスフォニウム組を使用し、存む金具 (例えば、フェニルリチウム。ブチルリチウムな ど)を用いてエーテル以(引えば、エーテル・ジ ピニルエーテル。テトタヒドロフタンなど)中で 必以に応じて加江下で化合物しと反応させるか。 あるいはアルカリ金口アルコキサイド(例えば・ ナトリウムノデラート。ナトリウムエデラートな と)を用いてルコやサイドと対応するアルコール 中で反応させるのが沿分交段的である。反応は沿

- 4 -



することにより。及降において目的化合物を得る ようにすることができる。

なお、以外化合物「はハロゲノビリジン気にフェノール気立たはチオフエノール気を必受に応じて担応性の質の存在下に反応させることにより、 ご遊される。

かくして得られた心合物目はあらに分口、和口 あるいは口類化、その他の必要に応じて、江当な アルカリ会口紅(何えば、ナトリカム、カリウム など)、アルカリ土同会口紅(例えば、カルシウム、マグネシウム、バリウムなど)、その他アル ミニウム包などに吊法に使って登録することがで みる。

本環명方法の目的化合物である[1]、原口国際は一国政体及びその担口は何れた抗災症作用(抗りウェデ作用も合ひ)立たは何即作用も示し、展現立たは回物にとして行用な化合物である。

以下交口例において本発明方法の交口目のを示

はいない

対象にしたメトゥシェテレントリフェニルフォスフォリクムクロライド23248をエーテル250以に図印し、内図ノ5~20℃でノノ25をルフェニルリテクムエーテル記録60以を招下位ノ5℃でノ5分回かるまぜる。2ーフェノキシーメーアをテルピリシングノ40のエーテル記録イ40以を30分で向下位記録で人は時間からませる。不認為を記去し評談に氷水を住びエーテルで抽出する。抽出弦を水洗、吃負益記憶を留去し扱証ノス628をシリカゲルカラムクロマトに付す。ペンゼン/体ロエテル(50:ノ)終出認を減圧減留すると bpa6に対ノ47~/49℃の2ーフェノキシー5ー(ノーノテルー2ーノトウシビニル)ピリンよ420を得る。

元記分析 C,3H,3O3Nとして 計算句: C.7446; H.427; N.189 費口句: C.749¢; H.437; N.179 IR v^{CHC03} m^{-/} /658./590 PMR 8(CDC03) /888./95(3H.6)./367. 270(3H.0).4/2.433(3H.9)

- 7 -



Mo モメテル茲、Mol ロメトキンび、Bl ロエテル茲、
Pr ロブロビル茲、i-Pr =イソプロビル茲、
Bu ロブテル茲、i -Bu ロイソブテル茲、
ロ-Bu エローブテル茲、i -Bu コ・ーブテル茲、
Ac =アセテル茲、Ao =アニリノ茲。
Co(aE」O)=カルンクト紅(ロ水取殻)。
、
Ad =アルミニク上型、d =分原点。
(以下余白)

74E2155-162772(3)

本品人ならりを2N口口500kmな、20気気は中一収からなぜた食屋応収にペンゼン/00を入れ口は気流中凸マンガン印かりクム人39の水溶は300を20分では下さらに食包で/0分回からをぜた食不好なを記去し記憶を設し水なナトリケムで直3~4としてエーテルで抽出する。抽出心を3分炭口水なナトリケムな溶液で抽出し、/0分包口で呼ばとした食エーテルで再び抽出する。抽出でを水洗、残りしに食を含まする。 没なる/09を水洗、残りしに飲を含まする。 没なる/09を水洗、残りしに食べをでまする。 公前は他の方法により口口された口品と同定された。

又以例2-103

以下以応問!と関切にして下記の化合物を得る。 なお、下記録中で用いられる自分は下記の意味を 取わし、A 間において得えばユーロはピリッン町 の3位がエーテル結合していることを変わし、X,、 X₃、Y,、Y₃対よびY₃間において例えばめてがはク ロルが母数の単位を目録していることを変わす。

-8-

		ان																									_		_		1
1	(D) &	\$\$\$ /~\$\$ /		-	_	8 8m	-		3//~9// H	B Co(38,0)/35/36	H Co (Mar)o) No-A/4	H A068~65	R /25~/304	PE0/~/0/ H	H //45-//53	46~26 H	H Co (MH 10)/60~/6/	H Cu(/(H/30)/55	H 92~03		p90/~50/ H				_				Ca (dayo) 244		N Columnia
H Q	, p	Ħ	耳	Ħ	叫	-	E	H H			_ #	<u></u>	Д	ᇤ	×	Ħ	æ	Ħ	=	=		=	: 12	; ;	; :	4 5	9 1	¤ :	= 1	= :	≖
X3	ξ, 'A	H	K-CS H	Ħ	3-c1 H	₽Cℓ H	H IJ-W	H	#-C 0 H	H	چد ر	g co	8-E01		Œ	ងុំ	=	1 o K			3 2		2 2 3		2 .	•		•			#0-9
		1_		_	F	Ħ	=	Ħ	×	Ħ	×	×	×	=	×	7		. 7	5	5 , \$	4 :	4	# :	E	=	=	X	Ħ	4	×	*
	H'H	=	Ħ	=	_	_	_	=	·	E	=	34	×	=		: =	: =	9 :	4 ;	4 1	=	=	= :	×	Z.	瓜	pp.	×	耳	#	E
4	1	=	**	, pa	=	~	-			-	-	00	· e	, q	0			ָר בּי בּי	0-9	3-0	ò-9	e T	9-0	9	9	8 - 8	9	3-0	3-0	9-9	
.1	4	١٩	י פ	9	707	9	3-0	2-0	0-9	8-0	10	3-8	7	7-0-4	1		.	•	Ġ	'n	Ġ	À	49	-8							- [
	, M	ş		_			มี	ង្គ	Í	ង្គ	ជ័	i 2	ź	ž	į	3 :	ដី ;	ដ	ž	ñ	ฆ	ų	ផ	ង	ี่	มี	Ŋ	윒	Ŋ	ž	원
	ECONTACT THE		. P	* ;	o :	3 2		, °	, ~	, ,	9 -	n =	s :	* *	•	.		3	m	*	m	.34	er.	3	*	ه.	*	*	*	.	3
	ROX		73	P)	3 5 ·	ν ·	a e		· ·	- 9	<u> </u>	`	2	/3	* _	٤/	9/	//	81	6/	30	3/	33	33	34	35	38	37	38	29	30

-10-

						-	: <u>!</u>																												999/	
1	7.6 d	33d	434	37 d	081				`	36	~	9//		0	n	/3/	į ,		•		, ;	107~108	Ca (2H30)/95d	Co (#101/674	Ca((411/) 2024	133~13#4	103~10&d	138-139	113~114	95/~55/	135-136	Ca (25H20)/694	135~1368	/36~/27d	Ca (/,5H,0) /65~/666	1300-1315
(a) b	1-511	133~133	143~1434	136~1374	304~208 J	0077077		7 38 m 3 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7	151~051	135~136	93~93	11~511	66-96	63~69	81-83	130~131	70708		185-180		26~270	107	20	ວິ	7) TO	, 23.	103	-	_	-					_	
۲,	×	×	×	=		4 :	z i 1	xi.	Ħ	×	#	I	E	Ħ	#	=	4 2	4 '	pt :	z	Ħ	×	Ħ	Ħ	Ħ	Ħ	Ħ	ž	ST-N	Ž,	0H-9		4			. 5
~	×	**	H	=	= 1	=	×	ئ	#	×	×	3-K	Ħ	×	: =	1	3	2	## 1	Ħ	ğ	Ħ	\$ -S	£ ₹	& 24	มี	a L	,	4 A	\$1 \$	₩-₩	- 1	, 1	, N	1	-0' £ 13)-
, `	W-NO.	· HX	2		K-NAC GOE!	«→NHCOA»		ユザーベンブ	8-CN	**		, Mark		;	ž :	Į,	e P	3-150	虹	4-1-Bo	0 F- K	Ħ	2-48 86	94°	유	ž,	on t	97-K	, F	, N	į		5 . T	\$:	2 - S	73-(cn3,6-
, z	1			-	<u> </u>	₹	H &-Br	×	æ	×	. =	, 1 P		4	Σ	int Lut	121 121	m ==	Ħ	×	×	Ħ	×	=	×	펖	Ħ	=	=	; p	4 0	: :	_			e e
× ×	=			_ ≅	=	20	Ħ	¥	*	W-W		:	= 1	z:	×	p#	Ħ	Ħ	Ħ	Ħ	×	Ž	*	×	Ħ	, # 4	=	-			•	_				
	1		9	9-0	3-0	0-4	o 1	0	, 9				0-9	9-0	0-9	0-9	0-9	9-0	0-7	0-9	3-0	0-4	0-7	0 1	0-7	2-0	•		9	0-9	-					0-9
-V- 8	- 1		ri N	ų.	180 3	ร์ มี	9 9 1		•	-	-	-	ž	มื	<u>2</u>	2	됬	มี	រ័	ä	ä	ğ	ź	ź	1 5	ž	1 :	និះ	B	원 :	ñ	ដ	윒	ň	å	Ä
Altroom	ומקור	ಶ	*	*	Ą	3	. ^	, :	s '	In	*1	m,	m	m	m	~1	m	æ	, m	, ^	, ?	. •	۰,	۰ ·	، بر 	n :	3	8	~	m	m	m.	~	*	3	· ·
RECENT	┪	3/	7	- 6	- 7	-	: :	9	37	38	39	0 #	/#	63	£ 3	5		? ;	2 2		8 2	4	20	>	25	4	3	5.5	\$	52	8	\$9	60	8	63	63

印起以	の(女□ CEC COOH B	R	-A-	х,	n	Υ,	٧,	Yg	ç γ (°C	>
65	3	Mo	6-0	Ħ	Ħ	23-~	ンゾ、	Ħ	/3/~/3	2
66	3	Me	6-0	&-Mo	5-Me	H	H	H	184~14	\$
67	¥.	Мe	2-0	56 -	ベンノ	H	H	Ħ	Ca (%H&)	216~217
68	3	Mo	4-0	45-	ペング	H	Ħ	H	122~12	3
69	3	Me	4-0	45-((CH _a) _o -	Ħ	H	H	151~15	2 .
70	3	Mo	6-0	H	H	34-(CH	,) ₅ –	H	1225~1	235
71	3	Me	p 6-0	H	H	3—Me t	H	Ħ	69.5~7Q	\$
73	3	Me	4-0	2-Me	45—M a	H	H	Ħ	C°(\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\) <i>2/8</i> d
73	3	Me	6-0	H	Ħ	₩-OH	H	Ħ	167~16	9
74	3	Me	6-0	H	H	4-AcO	H	Ħ	161~16	2
75	. з	Мо	6-0	H	H	%— i −P r	H	H	89~91	,
76	3	Ma	6-0	H	Ħ	u−P r	H	H	81.5~82	. S
77	3	Me	6-0	H	H	4 − €−B u	H	H	113~11	3
78	3	Mo	6− 0	H	н	44— a −B a	Н	H	67~7/	
79	3	Mo	4-0	H	Ħ	4∕Bu	H	H	Ca(H_O)/4	40~142
80	3	Me	6-0	H	Ħ	4 -1-B□	H	H	Co /15-	//9(d)

E A



Y, Y, CH,	

10 A	, ×	ਮੌ	71.7 本が語の位口	*	*	メ * 6 * 4 * 6 * 4 * 1 * 1 * 1 * 1 * 1 * 1 * 1 * 1 * 1 * 1	(۵) ۵
1	=	Ħ	7	Ħ	×	~ 3	26-77
83	量	Ħ	ч	œ.	×	*	139~130
. S	No.	Ħ	Ŋ	×	Ħ	*	005~861
38	S-CONH,	×	ч	Ħ	Ħ	*	311-313
2	=	×	'n	×	Ħ	\$	130~131
8.6	껇	#	*	ĸ	×	*	181-081
63	3&-(CH ₂),0-	1, (L	n	x	Ħ	\$	166~167
20	ユダーペンン	7.7	ฯ	Ħ	=	*	145~147
6.0	มี	4-M	ч	Ħ	=	*	1555~156
9.0	ยื	S-Mo	7	Ħ	Ħ	ತ	143~143
16	%-W	#	ч	Ħ	Ħ	æ	123~13#
9.3		¤	~	ĸ	Ħ	*	Co (H ₂ O)273-275
93		Ħ	ч	Ħ	Ħ	*	137~138
200	SP-E	×	*	Ħ	Ħ	3	153~153
9.5	និ រ -ទ	Ħ	ч	Ħ	×	*	132~134
9	អ្នំ	Ħ	. 41	.	Ħ	*	131~133
83	. 🕦	E	๗	Į,	Ħ	3 5	801~401
86	· #	Ħ	ฟ	3-Mot	Ħ	**	Co (48 30)/584
66	١	Ħ	4	. ¤	=	*	136-138
100	Ħ	Ħ	า	å G	×	*	180-181
101	Ħ	Ħ	ч	3-6	Ħ	*	66~86
101	×	Ħ	7	7 -€	Ħ	*	911-511
103	=	Ħ	ď	3-6	2	*	137~138

特別昭55-182772(6)

実施別 / 0 ギー / 0 7

実施例!と同様にして下記の化合物を得る。

ユー(ムー (ユービリジルオキシ) ーユーナフ チル)プロピオン数、甲/タク~/タ8℃。

ユーじ 4ーく / ーフエニルー / ユネダーテトラ

ゾリルオキシ) フェニル) プロピオン酸 . 平/65

ユー(4ー(ユーピリミジルオキシ) フェニル)プロピオン酸、甲/ ク4~/ クよで。

ユー(4ー (/ーノチルーユーペンズイミダゾ イルオキシ) フエニル] プロピオン酸,甲/84 ~/85℃。

> 特許出顧人 塩野義製業株式会社 代 理 人 弁理士 岩崎 光龍

第1頁の続き

動Int. Cl.3 識別記号 庁内整理番号 #A 61 K 31/415 A B G 31/44 A B E 31/455 A A H 31/47 A B G

②発明 者 岡田哲夫

堺市三条通2の5